PAT-NO:

JP408027120A

DOCUMENT-IDENTIFIER: JP 08027120 A

TITLE:

TETRAHYDROPYRIMIDINONE DERIVATIVE

PUBN-DATE:

January 30, 1996

#### INVENTOR-INFORMATION:

NAME

COUNTRY

MITA, TAKESHI

NUMATA, AKIRA

ISHII, SHIGERU

KUDO, MASAKI

INOUE, YOICHI

MIYAKE, TOSHIRO

### ASSIGNEE-INFORMATION:

NAME

COUNTRY

NISSAN CHEM IND LTD N/A

APPL-NO:

JP06157053

APPL-DATE: July 8, 1994

INT-CL

C07D239/22 , A01N043/54 , A01N043/56 , A01N043/58 ,

(IPC):

A01N043/60 , A01N043/647 , A01N043/653 , A01N043/76 , A01N043/78 , A01N043/80 , A01N043/80 , A01N043/832 ,

A01N043/836 , C07D401/12 , C07D403/12 , C07D403/12 ,

C07D403/12 , C07D403/12 , C07D403/12 , C07D405/12 ,

C07D409/12 , C07D413/12 , C07D417/12

### ABSTRACT:

PURPOSE: To obtain a new compound having excellent insecticidal and acaricidal activities against various kinds of agricultural harmful insects and spider mites, almost free from harmful effects against mammals, fishes and beneficial insects and useful as pest controlling agent.

CONSTITUTION: This is a compound of formula I (R1 and R2 are each H, a 1-6C alkyl, a 3-6C cycloalkyl, a 2-6C alkenyl, a 2-6C alkoxyalkyl, a (substituted) phenyl, etc.; X1 and X2 are each a halogen, a 1-4C alkyl, a 1-4C alkoxy, a 1-4C alkylthio, NH2, CN, NO2, etc.; l=0-4; Y is a halogen, a 1-6C alkyl, a 2-6C alkenyl, a 2-6C alkynyl, a 3-6C cycloalkyl, a 1-6C alkoxy, NO2, CN, OH, carboxyl, etc.; m=1-5; Z is O, S or NH), e.g. 1-(4-chlorophenyl)-4-(2,6-difluorophenyl)-1,2,3,6-tetrahydropyrimidin-2-one. The compound is obtained by reacting a compound of formula II with a compound of formula III (M is an alkali metal) in an inert solvent.

COPYRIGHT: (C) 1996, JPO

(19)日本国特許庁(JP)

### (12) 公開特許公報(A)

(11)特許出顧公開番号

特開平8-27120

(43)公開日 平成8年(1996)1月30日

(51) Int.CL<sup>6</sup>

識別記号 庁内整理番号

FΙ

技術表示箇所

C 0 7 D 239/22

A01N 43/54

С

43/56

A01N 43/82

103

104

審査請求 未請求 請求項の数4 OL (全36頁) 最終頁に続く

(21)出顕番号

特顯平6-157053

(71)出願人 000003986

日産化学工業株式会社

(22)出顧日

平成6年(1994)7月8日

東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1

(72)発明者 三田 猛志

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学

工業株式会社中央研究所内

(72)発明者 稻田 昭

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学

工業株式会社中央研究所内

(72)発明者 石井 茂

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学

工業株式会社中央研究所内

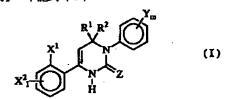
最終質に続く

### (54) 【発明の名称】 テトラヒドロビリミジノン誘導体

(57)【要約】

(修正有)

【構成】 下記式(I)



〔式中、 $R^1$  及び $R^2$  は水素原子、 $C_1 \sim 6$  アルキル基、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル基など、 $X^1$  及び $X^2$  はハロゲン原子、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ基など、Yはハロゲン原子、 $C_1 \sim 6$  アルキル基、 $C_2 \sim 6$  アルケニル基など、Zは酸素原子、イオウ原子又はイミノ基、Mは $1 \sim 5$ の整数を示す〕で表されるテトラヒドロビリミジノン誘導体及びそれを含有する有害生物防除剤。

【効果】 この化合物は多くの農業害虫、ハダニ類に対して優れた殺虫・殺ダニ活性を有し、かつホ乳類、魚類及び益虫に対してはほとんど悪影響を及ぼさない、従って有用な有害生物防除剤を提供することができる。

1

【特許請求の範囲】 【請求項1】 一般式(I) 【化1】

$$X^{1} \longrightarrow \begin{pmatrix} R^{1} R^{2} & Y_{m} \\ N & Z \end{pmatrix}$$

$$X^{2} \longrightarrow \begin{pmatrix} N \\ H \end{pmatrix} Z$$

$$(1)$$

キル基、C3~Csシクロアルキル基、C2~Csアルケニル 基、C2~Gアルキニル基、G~Gシクロアルケニル基、 C1~C6ハロアルキル基、C2~C6アルコキシアルキル基、 C3~C6ハロシクロアルキル基、C2~C6ハロアルケニル 基、Ca~Gのロアルキニル基、または無置換もしくは置 換されていてもよいフェニル基 (ただし、置換されてい てもよい置換基としてはハロゲン原子、GーGアルキル 基、C1~Gハロアルキル基、C1~Gアルコキシ基、G1~ Gハロアルコキシ基、C1~Gアルキルチオ基またはG~ Gハロアルキルチオ基を示し、置換基が2個以上の場合 20 は置換基は同一であっても異なっていてもよい)を示

X1、X2は各々独立して、ハロゲン原子、C1~Gアルキル 基、C1~Gアルコキシ基、C1~Gアルキルチオ基、C1~ Gハロアルキル基、GーGハロアルコキシ基、GーGハ ロアルキルチオ基、アミノ基、シアノ基、またはニトロ 基を示し、1は0~4の整数(ただし、2~4の場合、 X<sup>2</sup>は同一であっても異なっていてもよい)を示し、 Yはハロゲン原子、C1~Csアルキル基、C2~Csアルケニ ル基、C2~C6アルキニル基、C3~C6シクロアルキル基、 C1~C6ハロアルキル基、C2~C6ハロアルケニル基、C2~ Coハロアルキニル基、Co~Coハロシクロアルキル基、Co ~Coシアノアルキル基、Co~Coヒドロキシアルキル基、 C2~C6カルボキシアルキル基、C1~C6アルコキシ基、C2 ~Coアルケニルオキシ基、Co~Coアルキニルオキシ基、 C3~C6シクロアルキルオキシ基、C1~C6ハロアルコキシ 基、C2~Gハロアルケニルオキシ基、C2~Gハロアルキ

ニルオキシ基、C3~C6ハロシクロアルコキシ基、G~C7 ハロシクロアルキルアルコキシ基、C1~G2アルキルチオ 基、C2~Geアルケニルチオ基、C2~Geアルキニルチオ 基、G~Gシクロアルキルチオ基、G~Gハロアルキル チオ基、C1~C6アルキルスルフィニル基、C2~C6アルケ ニルスルフィニル基、C2~C6アルキニルスルフィニル 基、C3~C6シクロアルキルスルフィニル基、C1~C6ハロ アルキルスルフィニル基、C1~C6アルキルスルホニル 基、C2~C6アルケニルスルホニル基、C2~C6アルキニル 〔式中、R1、R2は各々独立して、水素原子、C1~Geアル 10 スルホニル基、C3~Geシクロアルキルスルホニル基、C1 ~Gハロアルキルスルホニル基、G~Gアルコキシアル キル基、C2~G2アルコキシアルコキシ基、C2~G2ハロア ルコキシアルキル基、C2~Ceハロアルコキシアルコキシ 基、C2~C6アルキルチオアルキル基、C2~C6アルキルチ オアルコキシ基、C3~Gアルコキシカルボニルアルキル 基、C3~C6アルキルカルボニルアルキル基、C2~C6アル コキシカルボニルオキシ基、C2~Gアルキルカルボニル オキシ基、C2~Csアルキルカルボニル基、C3~Csアルケ ニルカルボニル基、C3~Csアルキニルカルボニル基、C4 ~C<sub>1</sub>シクロアルキルカルボニル基、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル カルボニル基、C2~C6アルコキシカルボニル基、C2~C6 ハロアルコキシカルボニル基、G~Gアルコキシカルボ ニルアルコキシ基、ニトロ基、シアノ基、ヒドロキシ 基、カルボキシル基、チオシアネート基、イソチオシア ネート基、C2~Ceチオシアネートアルキル基、C1~Ceア ルキルスルホニルオキシ基、C2~Ceアルキルチオカルボ ニル基、アミノ基(-NR3R4)、アミノカルボニル基(-CONR 3R4)、アミノカルボニルオキシ基(-OCONR3R4)、アミド 基(-NR3 COR4)、アルコキシカルボニルアミノ基(-NR3 CO2 P!)、アミノスルホニル基(-SOzNR3P!)、チオアミド基 (-NR3 CSR4)、メチレンジオキシ基、ハロメチレンジオキ シ基、エチレンジオキシ基、ハロエチレンジオキシ基、 トリメチルシリル基または

【化2】

{ただし、Wは 【化3】

(ただし、R3およびR4は各々独立して水素原子、C1~G アルキル基、C2~G2アルケニル基、C2~G2アルキニル 基、C1~C6ハロアルキル基、C2~C6ハロアルケニル基、 C2~C6ハロアルキニル基、C2~C6アルキルカルボニル 基、C2~G2アルコキシカルボニル基、フェニル基または 20 ベンジル基を示し、PPおよびPPは各々独立して水素原 子、ハロゲン原子、C1~Gsアルキル基、C3~Gsシクロア ルキル基、シアノ基またはフェニル基を示し、

qは0~2の整数を示す。)を示し、

nは0または1の整数を示し、

Arは無置換または置換されていてもよいフェニル基、ナ フチル基、フリル基、チエニル基、ピロリル基、ピラゾ リル基、イミダゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリ ル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、オキサジ アゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、ピリ 30 ジル基、ピリダジル基、ピリミジル基、ピラジル基、キ ノリル基またはキノキザリル基(ただし、置換されてい てもよい置換基としてはハロゲン原子、シアノ基、ニト 口基、G~Gアルキル基、G~Gハロアルキル基、G~ Gアルコキシ基、C1~Gハロアルキコシ基、C1~Gアル キルチオ基、C1~Gハロアルキルチオ基、C1~Gアルキ ルスルホニル基、Cı~Gハロアルキルスルホニル基、Cı ~Gアルコキシカルボニル基、カルボキシル基、アミノ 基、モノC1~C4アルキルアミノ基、ジC1~C4アルキルア ミノ基、フェニル基、ベンジル基、メチレンジオキシ基 40 またはハロメチレンジオキシ基を示し、置換基が2個以 上の場合は置換基は同一であっても異なっていてもよ い)を示す。}を示し、

mは1~5の整数 (ただし、2~5の場合はYは同一で あっても異なっていてもよい)を示し、

Zは酸素原子、イオウ原子またはイミノ基を示す。〕で 表されるテトラヒドロビリミジノン誘導体。

【請求項2】 R1、R2が各々独立して水素原子またはC1 ~Coアルキル基を示し、

\*~Gアルコキシ基を示し、

Yがハロゲン原子、C1~Csアルキル基、C1~Csアルコキ シ基、C1~Gハロアルキル基、C1~Gハロアルコキシ 基、ニトロ基または置換されていてもよいピリジルオキ シ基 (ただし、置換されていてもよい置換基としてはハ ロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、Ci~Ceハロアルキル 基またはCi~Ceハロアルコキシ基を示し、

Zが酸素原子を示し、

1が0~2の整数を示し、

mが1~3の整数を示す請求項1記載のテトラヒドロビ リミジノン誘導体。

【請求項3】 請求項1記載のテトラヒドロピリミジノ ン誘導体の1種または2種以上を有効成分として含有す ることを特徴とする有害生物防除剤。

【請求項4】 請求項2記載のテトラヒドロピリミジノ ン誘導体の1種または2種以上を有効成分として含有す ることを特徴とする有害生物防除剤。

【発明の詳細な説明】

[0001]

【産業上の利用分野】本発明は、新規なテトラヒドロピ リミジノン誘導体誘導体ならびに該誘導体を有効成分と して含有する有害生物防除剤に関する。

[0002]

【従来の技術】従来、テトラヒドロビリミジノン誘導体 に関してはいくつかの特許及び文献に記載がある。ヘテ ロサイクルス (Heterocycles) 14巻、2 85頁(1980)、ジャーナル・オブ・ケミカル・ソ サイヤティ・パーキン・トランス1 (J. Chem. S oc., Perkin Trans. 1) 489頁及び 1622頁(1981)、およびジャーナル・オブ・ヘ テロサイクリック・ケミストリー (J. Heteroc ycl. Chem. ) 18巻、1469頁(1981) には1位と4位にフェニル基を有する1,2,3,6-テトラヒドロビリミジンー2ーオンが記載されている

 $X^1$ 、 $X^2$ がハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基または $C_1 * 50$  が、上記文献には有害生物防除剤としての活性は何ら示

5

されていない。

【0003】又、ドイツ特許DE2142385には中 枢神経作用活性を有する4位にメタ位またはパラ位に置 換されたフェニル基を有する1,2,3,6-テトラヒ ドロピリミジンー2ーオンが記載されているが、本発明 の4位にオルト位に置換されたフェニル基を有する1, 2.3,6-テトラヒドロビリミジン-2-オンは記載 されていない。さらに有害生物防除剤としての活性は何 ら示されていない。

### [0004]

【発明が解決しようとする課題】殺虫剤の長年にわたる 使用により、近年、害虫が抵抗性を獲得し、従来の殺虫 剤による防除が困難になっている。また殺虫剤の一部は 毒性が高く、あるものは残留性により生態系を乱しつつ ある。よって低毒性かつ低残留性の新規な殺虫剤の開発 が常に期待されている。

【0005】本発明者らはテトラヒドロピリミジノン誘 導体について鋭意研究を重ねた結果、新規な1,4-ジ フェニルー1,2,3,6-テトラヒドロピリミジン-2-オン誘導体が低薬量で優れた殺虫活性を示し、かつ 20 ホ乳動物、魚類および益虫に対してはほとんど悪影響が ない極めて有用な化合物であることを見出し本発明を完 成した。

[0006]

【課題を解決するための手段】本発明は一般式(I) [0007]

【化4】

【0008】〔式中、R1、R2は各々独立して、水素原 子、C1~C6アルキル基、C3~C6シクロアルキル基、C2~ Csアルケニル基、Cz~Csアルキニル基、Cs~Csシクロア ルケニル基、C1~Gハロアルキル基、C2~Gアルコキシ アルキル基、C3~Csハロシクロアルキル基、C2~Csハロ アルケニル基、C2~Gハロアルキニル基、または無置換 もしくは置換されていてもよいフェニル基(ただし、置 換されていてもよい置換基としてはハロゲン原子、CI~ Gアルキル基、CI~Gハロアルキル基、CI~Gアルコキ シ基、C1~Gハロアルコキシ基、C1~Gアルキルチオ基 またはC1~Gハロアルキルチオ基を示し、置換基が2個 以上の場合は置換基は同一であっても異なっていてもよ い)を示し、X1、X2は各々独立して、ハロゲン原子、C1 ~Gアルキル基、C1~Gアルコキシ基、C1~Gアルキル チオ基、C1~C4ハロアルキル基、C1~C4ハロアルコキシ 基、C1~Gハロアルキルチオ基、アミノ基、シアノ基、 またはニトロ基を示し、1は0~4の整数(ただし、2 50

~4の場合、XPは同一であっても異なっていてもよい) を示し、Yはハロゲン原子、C1~G2アルキル基、C2~G3 アルケニル基、C2~Geアルキニル基、C3~Geシクロアル キル基、C1~C6ハロアルキル基、C2~C6ハロアルケニル 基、Cz~Gcハロアルキニル基、Cs~Gcハロシクロアルキ ル基、C2~C6シアノアルキル基、C1~C6ヒドロキシアル キル基、C2~Gカルボキシアルキル基、C1~Gアルコキ シ基、C2~Gcアルケニルオキシ基、C2~Gcアルキニルオ キシ基、C3~Gシクロアルキルオキシ基、C1~Gハロア 10 ルコキシ基、C2~C6ハロアルケニルオキシ基、C2~C6ハ ロアルキニルオキシ基、G~Gハロシクロアルコキシ 基、G~Gハロシクロアルキルアルコキシ基、G~Gア ルキルチオ基、C2~Ceアルケニルチオ基、C2~Ceアルキ ニルチオ基、C3~C6シクロアルキルチオ基、C1~C6ハロ アルキルチオ基、C1~C6アルキルスルフィニル基、C2~ Grルケニルスルフィニル基、Cr~Grルキニルスルフ ィニル基、C3~C6シクロアルキルスルフィニル基、C1~ Coハロアルキルスルフィニル基、Co~Coアルキルスルホ ニル基、C2~Gアルケニルスルホニル基、C2~Gアルキ ニルスルホニル基、C3~Gシクロアルキルスルホニル 基、C1~C6ハロアルキルスルホニル基、C2~C6アルコキ シアルキル基、C2~G2アルコキシアルコキシ基、C2~G ハロアルコキシアルキル基、Cz~Gハロアルコキシアル コキシ基、C2~C6アルキルチオアルキル基、C2~C6アル キルチオアルコキシ基、C3~C6アルコキシカルボニルア ルキル基、C3~Csアルキルカルボニルアルキル基、C2~ Coアルコキシカルボニルオキシ基、Ca~Coアルキルカル ボニルオキシ基、C2~C6アルキルカルボニル基、C3~C6 アルケニルカルボニル基、C3~C6アルキニルカルボニル 30 基、C<sub>4</sub>~C<sub>7</sub>シクロアルキルカルボニル基、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>ハロア ルキルカルボニル基、C2~C6アルコキシカルボニル基、 C2~C6ハロアルコキシカルボニル基、C3~C6アルコキシ カルボニルアルコキシ基、ニトロ基、シアノ基、ヒドロ キシ基、カルボキシル基、チオシアネート基、イソチオ シアネート基、C2~Coチオシアネートアルキル基、C1~ Coアルキルスルホニルオキシ基、Co~Coアルキルチオカ ルボニル基、アミノ基(-NR3P)、アミノカルボニル基(-CONR3 P4)、アミノカルボニルオキシ基(-OCONR3 P4)、ア ミド基(-NR3COR4)、アルコキシカルボニルアミノ基(-NR 3CO2R4)、アミノスルホニル基(-SO2NR3R4)、チオアミ ド基(-NR3 CSR4)、メチレンジオキシ基、ハロメチレンジ オキシ基、エチレンジオキシ基、ハロエチレンジオキシ

> [0009] 【化5】

<del>─</del>(W)—Ar 基

【0010】 {ただし、Wは

基、トリメチルシリル基または

[0011]

【化6】

7
$$-0- , -S- , -N- , -\frac{R^{5}}{R^{6}} , -\frac{C}{C}- , -$$

【0012】(ただし、R3およびR4は各々独立して水素 原子、C1~Csアルキル基、C2~Csアルケニル基、C2~Cs アルキニル基、C1~Gハロアルキル基、C2~Gハロアル ケニル基、C2~Ceハロアルキニル基、C2~Ceアルキルカ ルボニル基、C2~Gc アルコキシカルボニル基、フェニル 基またはベンジル基を示し、PPおよびR6は各々独立して 水素原子、ハロゲン原子、C1~Geアルキル基、C3~Gsシ クロアルキル基、シアノ基またはフェニル基を示し、q は0~2の整数を示す。) を示し、nは0または1の整 数を示し、Arは無置換または置換されていてもよいフェ ニル基、ナフチル基、フリル基、チエニル基、ピロリル 基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、チアゾリル基、イ ソチアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル 基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾ リル基、ヒリジル基、ヒリダジル基、ヒリミジル基、ヒ 30 ラジル基、キノリル基またはキノキザリル基(ただし、 置換されていてもよい置換基としてはハロゲン原子、シ アノ基、ニトロ基、G~Gアルキル基、G~Gハロアル キル基、CI~Gアルコキシ基、CI~Gハロアルキコシ 基、Ci~Gアルキルチオ基、Ci~Gハロアルキルチオ 基、C1~Gアルキルスルホニル基、C1~Gハロアルキル スルホニル基、C2~Gアルコキシカルボニル基、カルボ キシル基、アミノ基、モノCI~Gアルキルアミノ基、ジ C1~Gアルキルアミノ基、フェニル基、ベンジル基、メ チレンジオキシ基またはハロメチレンジオキシ基を示 し、置換基が2個以上の場合は置換基は同一であっても 異なっていてもよい)を示す。}を示し、mは1~5の 整数 (ただし、2~5の場合はYは同一であっても異な っていてもよい)を示し、Zは酸素原子、イオウ原子ま たはイミノ基を示す。〕で表されるテトラヒドロビリミ ジノン誘導体および該誘導体の1種または2種以上を有 効成分として含有する有害生物防除剤に関するものであ る。

【0013】本明細書において示した各置換基の例を以下に示す。なお、各置換基のうち炭素鎖は、直鎖、分岐\*50

\* 鎖又は環状の何れでもよい。以下、n-はノルマル、i ーはイソ、sec-はセカンダリー、t-はターシャリ ー、c-はシクロを意味する。

【0014】 Ci~Cgアルキル基としては、メチル基、エ テル基、n-プロピル基、i-プロピル基、c-プロピル基、n-プチル基、i-ブチル基、sec-ブチル基、t-ブチル基、n-ペンチル基、c ーペンチル基、n-ヘキシル基、c-ヘキシル基等が挙 げられる。

【0015】 C2~Gアルケニル基としては、エテニル基、2-プロペニル基、2-メチルー2-プロペニル基、2-ブテニル基等が挙げられる。

【0016】 G~Gアルキニル基としては、エチニル基、2-プロピニル基、2-ブチニル基等が挙げられる。

【0017】 C2~Gアルコキシアルキル基としては、メトキシメチル基、エトキシメチル基、1-メトキシエチル基等が挙げられる。

【0018】 C2~Cs アルキルカルボニル基としては、メチルカルボニル基、エチルカルボニル基、nープロビルカルボニル基、cープロビルカルボニル基、iーブチルカルボニル基、iーブチルカルボニル基、secーブチルカルボニル基、tーブチルカルボニル基、cーブチルカルボニル基等が挙げられる。

【0019】 C2~C6アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、nープロボキシカルボニル基、iープロボキシカルボニル基、cープロボキシカルボニル基、nーブトキシカルボニル基、iーブトキシカルボニル基、secーブトキシカルボニル基、tーブトキシカルボニル基、cーブトキシカルボニル基等が挙げられる。

【0020】ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子が挙げられる。

【0021】R1として好ましくは、水素原子又はC1~C6

アルキル基が挙げられる。

【0022】P<sup>2</sup>として好ましくは、水素原子又はC<sub>1</sub>~Geアルキル基が挙げられる。

【0023】X1及びX2として好ましくは、ハロゲン原子、C1~Gハロアルキル基またはC1~Gアルコキシ基が挙げられる。

【0024】Yとして好ましくは、ハロゲン原子、Ci~CGアルキル基、Ci~GGアルコキシ基、Ci~GGハロアルキル基、Ci~GGハロアルコキシ基、ニトロ基および置換されていてもよいピリジルオキシ基(ただし、置換されて 10いてもよい置換基としてはハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、Ci~GGハロアルコキシ基が挙げられる)が挙げられる。

【0025】 乙として好ましくは、酸素原子が挙げられる。

【0026】1は0~2の整数が好ましい。

【0027】mは1~3の整数が好ましい。

【0028】本発明化合物としては、下記の化合物が好ましい。R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>が各々独立して水素原子またはC<sub>1</sub>~G<sub>2</sub>アルキル基を示し、X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>がハロゲン原子、C<sub>1</sub>~G<sub>2</sub>ハロア 20ルキル基またはC<sub>1</sub>~G<sub>2</sub>アルコキシ基を示し、Yがハロゲ

ン原子、C1~Gアルキル基、C1~Gアルコキシ基、C1~Gハロアルキル基、C1~Gハロアルコキシ基、ニトロ基または置換されていてもよいピリジルオキシ基(ただし、置換されていてもよい置換基としてはハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1~Gハロアルキル基またはC1~Gハロアルコキシ基を示し、Zが酸素原子を示し、1がO~2の整数を示し、mが1~3の整数を示す式(I)で表されるテトラヒドロビリミジノン誘導体。

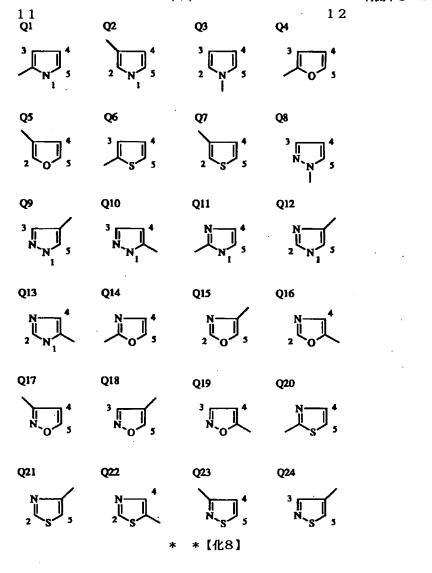
【0029】尚、本発明に包含される化合物の中で不斉 炭素原子を有する化合物の場合には、光学活性な化合物 S体及びR体が含まれる。更に、立体配置異性体が存在 する場合には、E体及びZ体が含まれる。

【0030】本発明に包含される化合物としては、具体的には例えば、第1表に示す化合物が挙げられる。但し、第1表の化合物は例示のためのものであって、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

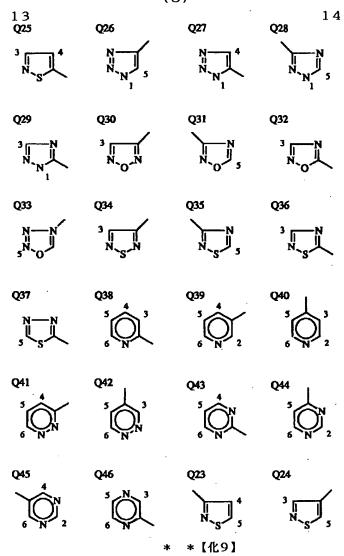
【0031】第1表の $Q1\sim Q61$ は次の式で表される基である。

[0032]

(化7)



[0033]



[0034]

R1	R²	Х1	X2 1	Y	Z
H	Н	F	6-F	4-F	0
H	H	<b>F</b> .	6-F	2-C1	0
H	H	F	6-F	3-C1	. 0
H	Н	F	6-F	4-C1	0
H	H	F	6-F	4-Br	0
H	H	F	6-F	4-I	0
H	H	F	6-F	4-CH <sub>3</sub>	0
H	H	F	6-F	4-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
H	H	F	6-F	4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	0
H	H	F	6-F	4-CH2CH=CH2	0
H	H	F	6-F	4-CH2 C ≡CH	0
H	H	F	6-F	4-051	. 0

4-SCHF2

Ö

[0038]

[0039]

H

H

F

6-F

	_		( :	11)	特開平8-27120
1 !		_			20
H	H	F	6-F	4-SCF <sub>3</sub>	0
H	H	F	6-F	4-SCF <sub>2</sub> C1	0
H	H	F	6-F	4-S0CH <sub>3</sub>	0
H	H	F	6-F	4-SOCH2 CH=CH2	0
H	H	F	6-F	4-S0(Q54)	0
H	H	F	6-F	4-S00F3	0
H	H	F	6-F	4-S02CH3	0
H	H	F	6-F	4-S02CH2CH=CH2	0
H	H 	F	6-F	4~SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH	0
H	H	F	6-F	4-S0 <sub>2</sub> (Q54)	0
H	H	F	6-F	4-S0 <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0 0
· H	H	F F	6-F 6-F	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHFC1	0
H. H	H H	r F		4-CH2OCH3 4-OCH2CH2OCH3	0
	H	r F	6-F		0
H			6-F	4-CH2 OCH2 CF3 4-OCF2 CHFOCF3	0
H	H	F F	6-F 6-F	4-cc+2 chrocr3 4-cH₂SCH₃	0
H 	,H		0-r .	4-unsuns	
			*	*【表4】	
Ri	R²	χ1	X21	Ya.	Z
Н	Н	F	6-F	4-OCH2 CH2 SCH3	0
H	H	F	6-F	4-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
H	H	F	6-F	4-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
H	H	F	6-F	4-CH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	0
H	H	F	6-F	4-0C0 <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
H	H	F	6-F	4-0C0CH3	0
H	Н	, <b>F</b>	6-F	4-000H <sub>3</sub>	0
H	H	F	6-F	4-00CH2 CH=CH2	0
H	H	F	6-F	4-00(Q53)	0
H	H	F	6-F	4-000F <sub>3</sub>	0
H	H	F	6-F	4-002 CH2 CH3	0
H	H	F	6-F	4-002C(CH3)3	0
H	H	F.	6-F	4-CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
H	H	F	6-F	4-0CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
H	H	F	6-F	4-NO <sub>2</sub>	0
H	H	F	6-F	4-CN	0
H	H	F	6-F	4-0H	0
H	В	F	6-F	4-00 <sub>2</sub> H	0
H	H	F	6-F	4-SCN	0
H	H	F	6-F	4-NCS	0
H	H	F	6-F	4-CH <sub>2</sub> SCN	0
H	H	F	6-F	4-0S0 <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
H 	H	F	6-F	4-CSCH₃	0 .
			*	《 ※【表5】	·
RI	R²	χı	X2 1	Y•	Z

[0040]

[0041]

			` `	/	• • •
2	1				22
H	H	F	6-F	4-NH2	0
H	H	F	6-F ·	4-N(CH3)2	0
H	H	F	6-F	4-N (CH3 ) CH2 CH2 CH3	0
H	H	F	6-F	4-N(CH3)CH2CH=CHCI	0
H	H	F	6-F	4-N (CH3 ) CH2 C6 H5	0
H	H	, <b>F</b>	6-F	4-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0
H	H	F	6-F	4-0CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	. 0
H	H	F	6-F	4-NHCOCH3	0
H	H	F	6-F	4-NHCO2 CH2 CH3	0
H	H	F	6-F	4-SO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0
H	H	F	6-F	4-NHCSCH <sub>3</sub>	0
H	H	F	6-F	4-Si (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	0
H	H	F	6-F	3-0CH <sub>2</sub> 0-4	0
H	H	F	6-F	3-0CF <sub>2</sub> 0-4	0
H	H	F	6-F	3-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-4	0
H	H	F	6-F	3-0CF2 CF2 0-4	0
H	H	F ·	6-F	4-CeHs	0
Н.	H	F	6-F	4-(C6H4-4-C1)	0
H	H	F	6-F	4-0C6H5	0
H	H	F	6-F	4-0(C6H4-4-C1)	0
H	H	F	6-F	4-0(C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub> )	. 0
H	H	F	6-F	$4-0(C_6H_3-2,4-Cl_2)$	0
H	H	F	6-F	4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0

[0042]

*	*	【表6】	l
---	---	------	---

R1	R²	χι	X21	Ye	Z
Н	Н	F	6-F	3-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0
H	H	F	6-F	4-S(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0
H	H	F	6-F	4-NH (C6 H3-2-C1-4-CF3)	0
H	H	F	6-F	4-N(CH2 CH2 CH3) (C6 H4 -4-C1)	0
H	H	F	6-F	4-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	0
Н	H	F	6-F	4-CF <sub>2</sub> (C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-Br)	0
H	H	F	6-F	4-COC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	0
H	Н	F	6-F	4-OCH2 (C6 H4-4-CF3)	0
H	H	F	6-F	4-CH2OC6H5	0
H	H	F	. 6-F	4-NHCH2 C6 H5	0
H	Н	F	6-F	4-CH2 CH2 C6 H5	0
H	H	F	6-F	4-CH=CH(C6H4-4-C1)	0
H	Н	F	6-F	4-N=NC6 Hs	0
H	H	F	6-F	4-OCH2 CH2 C6 H5	0 .
H	H	F	6-F	4-NHCON (CH3) (C6H4-4-C1)	0
H	H	F	6-F	4-NHCSNHC6H5	0
Н	H	F	6-F	4-OCH2 CH2 O (C6 H3-2, 4-Cl2)	0
Н	Н	F	6-F	4-CH2ON=C(Q51)(C6H4-4-C1)	0
Н	H	F	6-F	4-0(Q1-1-CH <sub>3</sub> )	0
Н	Н	F	6-F	4-0(Q2-1-CH <sub>3</sub> )	0
H	H	F	6-F	4-(Q3)	0
Н	н.	F	6-F	4-CH <sub>2</sub> (Q4)	0

0

				( 1	13)		邿
	2: H	3 H	F	6-F	4-(Q5)	24	
[0043]				*	*【表7】		_
·	R¹	R <sup>2</sup>	χı	X <sup>2</sup> 1	Ye ,	Z	_
•	Н	В	F	6-F	4-C≡C(Q6)	0	_
	Н	H	F	6-F	4-CH <sub>2</sub> (Q7)	0	
	H	Н	F	6-F	4-(Q8-3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )	0	
	Н	H	F	6-F	4-(Q8-3-C6H5)	0	
	Н	H	F	6 <b>-</b> F	4-0CHz (Q9-1-CH3)	0	
	Н	H	F	6-F	4-0(Q10-1-CH <sub>3</sub> )	0	
	Н	H	F	6-F	4-(Q11-1-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )	0	
	H	H	F	6-F	4-(Q12-1-CH <sub>3</sub> )	0	
	 H	н	F	6-F	4-0CHz (Q13-1-CHz)	0	
	н.	. Н	F	6-F	4-0(Q14-1-CH <sub>3</sub> )	0	
	Н	H	F	6-F	4-(Q15)	0	
	н	 H	F	6-F	4-0(Q16)	0	
	н	H	F	6-F	4-0(Q17-5-CH <sub>3</sub> )	0	
	H	H	Ł.	6-F	4-0(Q18)	. 0	•
	n H	·H	F	6-F	4-0(418) 4-0CH <sub>2</sub> (Q19)	0	
				0−r 6−F	4-0CH2 (Q20-4-C1)	0	
	Н	H	F			0	
	H	H	F	6-F	4-(Q21)		
	H	H	F	6-F	4-0CH <sub>2</sub> (Q22)	0	
	Н	H	F	6-F	4-(Q23)	. 0	
	. Н	H	F	6-F	4-0CH <sub>2</sub> (Q24)	0	
	H	H	F	6-F	4-0(Q25-3-CH <sub>3</sub> )	0	
	H 	H	F	6-F	4-(Q26-1-CH <sub>3</sub> )	0	
	H	H	F	6-F	4-0CH <sub>2</sub> (Q27-1-CH <sub>3</sub> )	0	
[0044]				*	《 ※【表8】	•	•
	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Хι	X <sup>2</sup> 1	Ya	Z	
	Н	Н	F	6-F	4-0CHz (Q28-1-CHz)	0	
	H	Н	F	6-F	4-0(Q29-1-CH <sub>3</sub> )	0	
	H	H	F	6-F	4-NHCONH (Q30)	0	
	H	H	F	6-F	4-0(Q31)	0	
	H	H	F	6 <b>∸</b> F	4-0CH2 (Q32)	0	
	H	H	F	6-F	4-0CH <sub>2</sub> (Q33)	. 0	
	Н	Н	F	6-F	4-0(034)	.0	
	Н	Н	F	6-F	4-0(036)	0	
	H	H	F	6-F	4-0CH2 (Q37-5-C1)	0	
	н	Н	F	6-F	3-0(Q38-3-C1-5-CF <sub>3</sub> )	0	
	н	H	F	6-F	4-0(Q38-3,5-Cl <sub>2</sub> )	0	
	н	Н	F	6-F	4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0	
	 H	. Н	F	6-F	4-NH (Q38-5-CF3)	0	
	H	. " H	F	6-F	4-(Q38-3-C1-5-CF3)	0	
	H	'' H	F	6-F	4-0(039-5-Br)	0	
		**		<i>.</i>	1 0 (40) 7 01)	·	

6-F

4-0(Q40-2,6-Cl<sub>2</sub>)

F

F

F

6-F

6-F

6-F

3-C1-4-OCF2 CHF2

3-C1-4-O(C<sub>6</sub> H<sub>4</sub>-4-CF<sub>3</sub>)

 $3-C1-4-O(C_6H_3-2-C1-4-CF_3)$ 

0

0

0

H

H

H

H

H

Н

[0045]

[0046]

日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日 日	28 5-CF3) 0
H H F 6-F 3-CF3-4-CI H H F 6-F 3-CH3-4-Br H H F 6-F 3-OCH3-4-CF3 H H F 6-F 3-CCH3-4-Br H H F 6-F 3-C1-4-I H H F 6-F 3-C1-4-I H H F 6-F 3-C1-4-CH3 H H F 6-F 2,3,4-F3 H H F 6-F 2,4,5-F3 H H F 6-F 2,5-F2-4-CI H H F 6-F 2,5-C12-4-OCF2 CHF2  ** * [表1 1]  R1 R2 X1 X21 Y <sub>n</sub> H H F 6-F 2,6-C12-4-CF3	5-CF3) O
H H F G-F 3-CH <sub>3</sub> -4-Br H H F G-F 3-OCH <sub>5</sub> -4-CF <sub>3</sub> H H F G-F 3-CI-4-Br H H F G-F 3-CI-4-I H H F G-F 3-CI-4-F H H F G-F 3-CI-4-CH <sub>3</sub> H H F G-F 2,3,4-F <sub>3</sub> H H F G-F 2,4,5-F <sub>3</sub> H H F G-F 2,5-F <sub>2</sub> -4-CI H H F G-F 3,5-F <sub>2</sub> -4-CI H H F G-F 2,5-Cl <sub>2</sub> -4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> * * [表1 1]  R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> X <sup>1</sup> X <sup>2</sup> <sub>1</sub> Y <sub>n</sub>	
H H F G-F 3-0CH2-4-CF3 H H F G-F 3-CF3-4-Br H H F G-F 3-C1-4-I H H F G-F 3-C1-4-F H H F G-F 3-C1-4-CH3 H H F G-F 2,3,4-F3 H H F G-F 2,4,5-F3 H H F G-F 3,5-F2-4-CI H H F G-F 2,5-C12-4-CCF2 CHF2  **【表11】  R1 R2 X1 X21 Yn H H F G-F 2,6-C12-4-CF3	0
H H F 6-F 3-CF3-4-BF H H F 6-F 3-CI-4-I H H F 6-F 3-CI-4-F H H F 6-F 3-CI-4-CF3 H H F 6-F 2,3,4-F3 H H F 6-F 2,4,5-F3 H H F 6-F 2,5-F2-4-CI H H F 6-F 3,5-F2-4-CF2 H H F 6-F 2,5-CI2-4-CCF2  **【表11】  R1 R2 X1 X21 Yn H H F 6-F 2,6-CI2-4-CF3	. 0
H H F 6-F 3-C1-4-I H H F 6-F 3-C1-4-F H H F 6-F 3-C1-4-CH <sub>3</sub> H H F 6-F 2,3,4-F <sub>3</sub> H H F 6-F 2,4,5-F <sub>3</sub> H H F 6-F 2,5-F <sub>2</sub> -4-CI H H F 6-F 3,5-F <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub> H H F 6-F 2,5-C1 <sub>2</sub> -4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> * * 【表1 1】	0
H H F 6-F 3-C1-4-F H H F 6-F 3-C1-4-CH3 H H F 6-F 2,3,4-F3 H H F 6-F 2,4,5-F3 H H F 6-F 2,5-F2-4-C1 H H F 6-F 3,5-F2-4-CF3 H H F 6-F 2,5-C12-4-OCF2 CHF2  **【表11】  R1 R2 X1 X21 Ya H H F 6-F 2,6-C12-4-CF3	0
H H F 6-F 3-Cl-4-CH3 H H F 6-F 2,3,4-F3 H H F 6-F 2,4,5-F3 H H F 6-F 2,5-F2-4-Cl H H F 6-F 3,5-F2-4-CF3 H H F 6-F 2,5-Cl2-4-OCF2CHF2  **【表11】  R¹ R² X¹ X²¹ Y <sub>n</sub> H H F 6-F 2,6-Cl2-4-CF3	0
H H F G-F 2,3,4-F3 H H F G-F 2,4,5-F3 H H F G-F 2,5-F2-4-C1 H H F G-F 3,5-F2-4-CF3 H H F G-F 2,5-C12-4-OCF2 CHF2  **【表11】  R1 R2 X1 X21 Yn H H F G-F 2,6-C12-4-CF3	0
H H F G-F 2,4,5-F3 H H F G-F 2,5-F2-4-Cl H H F G-F 3,5-F2-4-CF3 H H F G-F 2,5-Cl2-4-OCF2 CHF2  * * 【表11】  R1 R2 X1 X21 Y <sub>n</sub> H H F G-F 2,6-Cl2-4-CF3	0
H H F 6-F 2,5-F2-4-Cl H H F 6-F 3,5-F2-4-CF3 H H F 6-F 2,5-Cl2-4-CF2CHF2  **【表11】  R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> X <sup>1</sup> X <sup>2</sup> 1 Y <sub>n</sub> H H F 6-F 2,6-Cl2-4-CF3	0
H H F 6-F 2,5-F2-4-Cl H H F 6-F 3,5-F2-4-CF3 H H F 6-F 2,5-Cl2-4-CF2CHF2  **【表11】  R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> X <sup>1</sup> X <sup>2</sup> 1 Y <sub>n</sub> H H F 6-F 2,6-Cl2-4-CF3	0
H H F 6-F 2,5-Cl <sub>2</sub> -4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> * * 【表1 1 】  R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> X <sup>1</sup> X <sup>2</sup> <sub>1</sub> Y <sub>n</sub> H H F 6-F 2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	0
H H F 6-F 2,5-Cl <sub>2</sub> -4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> * * 【表1 1 】  R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> X <sup>1</sup> X <sup>2</sup> <sub>1</sub> Y <sub>n</sub> H H F 6-F 2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	0
$egin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	0
H H F 6-F 2,6-C1 <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	
	· Z
	0
	0
H H F 6-F 3,4,5-Cl3	0
H H F 6−F 3,5−C12−4−0CF3	0
H H F 6-F 3,5-C12-4-OCF2CHF2	0
H H F 6-F 3,5-C12-4-0(C6H4-4	-C1) 0
H H F 6-F 3,5-C12-4-0(C6H3-2	-C1-4-CF3) O
H H F 6-F 3,5-C12-4-NH(C6H4-	4-CF <sub>3</sub> ) 0
H H F 6-F 3,5-Cl2-4-0(Q38-3-	C1-5-CF₃) O
H H F 6-F 3,5-C12-4-0(Q50-6-	CF <sub>3</sub> ) 0
H H F 6-F 2-F-4,5-C12	0
H H F 6-F 2-F-4-OCF2CHF2-5-C	:1 0
H H F 6-F 2,3,4,5-F4	0
H H F 6-F 2,4-F2-3,5-C12	0
H H F 6-F 2,6-F2-3,5-Cl2	0
H H F 6-F 2,3,4,5,6-F5	. 0
H H F 6-F 4-OCH2 CH2 CH2 CH2	0
H H F 6-F 3-F-4-CH3	0.
H H F 6-F 2-Br-4-0CF3	0
H H F 6-F 4-(CH2)5 CH3	0
H H F 6-F 2-CH3-4-OCF3	. 0
Н Н F 6-F 4-000Св Нь	0 .
H H F 6-F 4-0S0 <sub>2</sub> CsH <sub>5</sub>	0
【0048】	
R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> X <sup>1</sup> X <sup>2</sup> <sub>1</sub> Y <sub>a</sub>	z
H H F 6-F 4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	. 0
H H C1 H 3-F	0
H H C1 H 4-F	0
H H C1 H 2-C1	0

			(	16)	特開平8-27120
29	•				30
H .	H	C1	H	3-C1	0
H	H	Cl	Н	4-Cl	0
H	H	C1	H	4-Br	0
H	H	C1	H	4-I	0
H	H	Cl	H	<b>4−CH</b> 3 .	0
H .	H	Cl	H	4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	0
H	H	C1	H	4-CHF <sub>2</sub>	0
H	H	Cl	H .	3-CF <sub>3</sub>	0
H	H	Cl	H	4-CF <sub>3</sub>	0
H	H	Cl	H	4-0CH3	0
H	H	Cl	H	4-0CH2 CH3	0.
H	H	Cl	H	4-0CHF2	0
H	H	C1	H	4-0CF2Br	0
H	H	Cl	H	2-0CF <sub>3</sub>	0
H	H	CI	H	3-0CF <sub>3</sub>	0
H	H	Cl	H	4-0CF <sub>3</sub>	0
H	H	Cl	H	4-0CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
H	H	C1	H	4-OCF2 CHF2	0
H	H	, C1	Н	4-OCF2 CHFC1	0
			<b>*</b>	* *【表13】	
R1	R²	χ1	X <sup>2</sup> 1	Ya	Z
Н	Н	Cl	Н	4-SCH <sub>3</sub>	0
H	H	C1	H	4-SCHF2	0
H	H	C1	H	4-SCF <sub>3</sub>	<b>0</b>
H	H	Cl	H	4-SCF2C1	0
H	H	Cl	Н	4-S0CH3	0
H	H	C1	H	4-SOCF <sub>3</sub>	<b>0</b>
H	H	Cl	H	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
H	H	C1	H	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
H	H	Cl	H	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHFC1	0
H	H	Cl	Н	4-OCF2 CHFOCF3	0
H	H	Cl	Н	4-COCH3	0
H	H	Cl	Н	4-00CF3	0
H	H	C1	Н	4-CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
H	H	C1	Н	4-NO <sub>2</sub>	0
H	H	Cl	H	4-CN	0
Ħ	H	Cl	. Н	4-CO <sub>2</sub> H	0
H	Н	Cl	H	4-N (CH3 ) CH2 CH2 CH3	0
H	H	Cl	H	4-NHCOCH₃	0
H	H	C1	H	3-0CH <sub>2</sub> 0-4	0
H	H	C1	Н	3-0CF <sub>2</sub> 0-4	0
H	Н	C1	. Н	3-0CF2 CF2 0-4	0
Н	H	C1	H	4-C6 Hs	0
H	H	CI	H	4-(C6H4-4-C1)	0
			<del></del>	※ ※【表14】	

[0049]

[0050]

			`	1 / /	1461
3	1			3 2	
R1	R²	X1	. X <sup>2</sup> 1	Ye	Z
H	Н	Cl	H	4-0(C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-C1)	0
H	H	C1	H	4-0(C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub> )	0
H	H	C1	H	4-0(C6H3-2,4-Cl2)	0
H	H	Cl	H	4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0
H	H	Cl	H	3-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0
H	H	Cl	H '	4-0CH2 (C6 H4-4-CF3)	0
H	H	Cl	H	4-CH2ON=C(Q51) (C6H4-4-C1)	0
H	H	Cl	H	3-0(Q38-3-C1-5-CF <sub>3</sub> )	0
H	H	C1	H,	4-0(Q38-3,5-Cl <sub>2</sub> )	0
H	Ħ	Cl	H	4-0(Q38-3-C1-5-CF₃)	0
H	H	Cl	H	4-(Q38-3-C1-5-CF <sub>3</sub> )	0
H	Н	Cl	H	4-0( <b>Q</b> 39 <del>-5-B</del> r)	0
H	H	Cl	H	4-0(Q40-2,6-Cl <sub>2</sub> )	0
H	H	Cl	Н	4-0(Q45-4-CF <sub>3</sub> -6-C1)	0
H	H	Cl	H	3-0(Q50-6-C1)	0
H	H	C1	H	2,4-F <sub>2</sub>	0
H	H	C1.	H	2,4-Cl <sub>2</sub>	0
H	H	C1	H	2,5-Cl <sub>2</sub>	0
H	H	C1	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	0
H	H	C1	H	3,5-C1₂	0
H	H	Cl	H	3,4-Br <sub>2</sub>	0
H	H	Cl .	H	2-F-4-C1	0
H	H	C1	H.	2-F-4-Br	0

[0051]

\* \*【表15】

Rı	R²	Χı	X <sup>2</sup> 1	Y.	Z
Н	Н	Cl	Н	2-F-4-00F <sub>3</sub>	0
H	H	C1	H	2-F-4-OCF2CHF2	0
H	H	Cl	H	2-F-4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0
H	H	C1	H	2-F-4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0
H	H	Cl	H	3-F-4-C1	0
H	H	C1	H	3-F-4-0(Q38-3-C1-5-CF <sub>3</sub> )	0
Н	H ·	Cl	H	2-C1-4-CF3	0
H	Н	Cl	H	2-C1-4-0(Q38-3-C1-5-CF <sub>3</sub> )	0
H	Н	C1 ·	H	3-C1-4-Br	0
H	Н	Cl	. Н	3-C1-4-CF3	0
H	H	Cl	H	3-C1-4-0CF <sub>3</sub>	0
H	H	C1	H	3-C1-4-OCF2 CHF2	0
H	Н	C1	H	3-C1-4-0(C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub> )	0
H	H	C1	H	3-C1-4-0(C6H3-2-C1-4-CF3)	O
H	Н	C1	H	3-C1-4-O(Q38-3-C1-5-CF3)	0
H	H	C1	H	3-C1-4-I	.0
H	H	C1	H	2, 3, 4-F <sub>3</sub>	0
H	Н	· C1	H	2, 4, 5-F <sub>3</sub>	0
H	H	C1	H	2,5-F2-4-C1	0
H	H	C1	H	2-F-4,5-Cl <sub>2</sub>	0

F

H

3,4-Br<sub>2</sub>

H

Н

0

[0054]

[0055]

Н

Н.

6-F

4-CH2ON=C(Q51) (C6 H4-4-C1)

[0056]

[0057]

H

H

. Н

H

Cl

C1

6-C1

6-C1

3,5-Cl<sub>2</sub>

3,4-Br<sub>2</sub>

0 0

3	9			. 40	
H	H	C1 .	6-C1	2-F-4-C1	0
H	H	C1	6-C1	2- <b>F-4-Br</b>	0
H	Н	C1	6-C1	2-F-4-0CF <sub>3</sub>	0
H	H	C1	6-C1	2-F-4-0CF2CHF2	0
H	H	C1	6-C1	2-F-4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0
H	H	C1	6-C1	2-F-4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0
H	H	C1	6-C1	3-F-4-C1	0
H	H	C1	6-C1	3-C1-4-Br	0
H	H	Cl	6-C1	3-C1-4-0CF3	0
H	H	C1	6-C1	2,5-F2-4-Cl	0
H	H	Cl	6-C1	2-F-4,5-Cl2	0
H	H	C1	6-C1	3,4,5-Cl <sub>3</sub>	0
H	H	C1	6-C1	3,5-C1 <sub>2</sub> -4-OCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	0
H	H	C1	6-C1	3,5-Cl <sub>2</sub> -4-0(Q38-3-Cl-5-CF <sub>3</sub> )	0
H	H	C1	6-C1	2,4-F2-3,5-Cl2	0
H	H	C1	6-C1	4-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
H	H '	Br	H .	4-C1	0
H	H	Br	H	4-Br	0
H	H	Br	- Н	4-CF <sub>3</sub>	0
H	H	Br	Н	4-0CF <sub>3</sub>	0
H	H	Br	H	4-OCF2 CHF2	0

[0058]

## \* \*【表22】

R1	R²	Х1	X <sup>2</sup> 1	Ya	Z
Н	Н	Br	Н	3-0CF <sub>2</sub> 0-4	0
H	H	Br	H .	4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0
H	Н	Br	Н	4-CH <sub>2</sub> ON=C (Q51) (C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-C1)	0
H	H	Br	H	4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0
H	H	Br	H	3, 4-Cl <sub>2</sub>	0
H	H	Br	H	3,5-Cl <sub>2</sub>	0
H	H	Br	H	3,4-Br <sub>2</sub>	0
H	H	Br	H	2-F-4-C1	0
H	Н	Br	H	2-F-4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0
H	H	Br	Н	2-F-4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0
H.	H	Br	H	3-F-4-C1	0
H	H	Br	H	3-C1-4-Br	0
H	H	Br	H	2,5-F <sub>2</sub> -4-Cl	0
H ·	H	Br	H	3,4,5-Cl <sub>3</sub>	0
H	H	Br	H	3,5-C12-4-OCF2CHF2	0
H	Н	Br	H	3,5-Cl2-4-O(Q38-3-Cl-5-CF3)	0
H	H	Br	, H	2, 4-F <sub>2</sub> -3, 5-Cl <sub>2</sub>	0
H	H	СНз	H	4-C1	0
H	H	СНз	H	4-Br	0
H	H	СНз	H	4-CF <sub>3</sub>	0
H	H	СНз	H	4-0CF <sub>3</sub>	0
H	H	СНз	Н	4-OCF2 CHF2	0
H	Н	СНз	H	3-0CF <sub>2</sub> 0-4	0

[0059]

\* \*【表23】

R1	R <sup>2</sup>	Χ¹	Χ2 1	Ya	Z
H	Н	CH3	Н	4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0
H	H	CH₃	H	4-CH2ON=C (Q51) (C6H4-4-C1)	0
H	H	СНз	H	4-0(Q38-3-C1-5-CF₃)	0
H	H	CH₃	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	0
H	H	СНз	Н	3,5-Cl <sub>2</sub>	0
H	H	CH₃	Н -	3,4-Br <sub>2</sub>	0
H	H	CH <sub>3</sub>	H	2-F-4-C1	0
H	H	CH3	H	2-F-4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0
H	H	CH₃	H	2-F-4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0
H	H	CH₃	Н	3-F-4-C1	0
H	H	CH₃	H	3-C1-4-Br	0
H	H	CH <sub>3</sub>	H	2,5-F2-4-Cl	0
H	H	CH₃	H	3,4,5-Cl <sub>3</sub>	0
H	H	СНз	H	3,5-C12-4-OCF2CHF2	0
H	H	CH <sub>3</sub>	H	3,5-Cl2-4-O(Q38-3-Cl-5-CF3)	0
H	H	СНз	Н	2,4-F <sub>2</sub> -3,5-Cl <sub>2</sub>	0
H	H	OCH <sub>3</sub>	H	4-C1	0
H .	H	OCH <sub>3</sub>	Н	4-Br	0
H	H	ОСНз	Н	4-CF <sub>3</sub>	0
H	H	OCH3	Н	4-0CF <sub>3</sub>	0
H	H	OCH <sub>3</sub>	À	4-OCF2 CHF2	0
H	H	OCH3	H	3-0CF <sub>2</sub> 0-4	0
H	H	OCH3	H	4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0

[0060]

# ※ ※【表24】

R1	R²	Χı	X <sup>2</sup> 1	Υ	Z
H	Н	OCH3	Н	4-CH2ON=C(Q51) (C6H4-4-C1)	0
H	H	OCH <sub>3</sub>	H	4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0
H	H	ОСН₃	H	3,4-Cl <sub>2</sub>	0
H	Н	ОСНз	H	3,5-Cl <sub>2</sub>	0
H	H	ОСН₃	Н	3,4-Br <sub>2</sub>	0
H,	H	ОСНз	Н	2-F-4-C1	0
H	H	ОСНз	Н	2-F-4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0
H	H	OCH3	H	2-F-4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0
H	H	OCH3	Н	3-F-4-C1	0
H	H	OCH3	H	3-C1-4-Br	0
H	H	OCH3	Н	2, 5-F2-4-C1	0
H	H	OCH3	Н	3,4,5-Cl <sub>3</sub>	0
H	H	OCH3	н	3,5-C12-4-OCF2CHF2	0
H	H	OCH <sub>3</sub>	Н	3,5-Cl <sub>2</sub> -4-0(Q38-3-Cl-5-CF <sub>3</sub> )	0
Н	Н	OCH3	H	2,4-F <sub>2</sub> -3,5-C <sub>12</sub>	0
H	H	СFз	Н	4-Cl	0
H	H	CF3	H	4-Br	0
Н	Н	СFз	H .	4-CF3	0

[0061]

[0062]

H

H

H

H

F

F

4,6-F2

4,6-F2

3,5-Cl2-4-OCF2 CHF2

3,5-Cl<sub>2</sub>-4-0(Q38-3-Cl-5-CF<sub>3</sub>) 0

3-C1-4-Br

0

[0063]

[0064]

H

H

Cl

4-F

```
(25)
                                                                                                 特開平8-27120
                                                                                       48
   47
                     Cl
                                   4-F
                                                   2,5-F2-4-C1
H
         H
                                                                                               0
H
         H
                     Cl
                                   4-F
                                                   3,4,5-Cl<sub>3</sub>
                                                                                               0
                     Cl
                                   4-F
                                                    3,5-C12-4-OCF2CHF2
H
          H
                     Cl
                                   4-F
                                                    3,5-C12-4-0(Q38-3-C1-5-CF3)
H
          Н
H
          H
                     Cl
                                   4-F
                                                    2,4-F2-3,5-Cl2
                                                    4-Cl
                                                                                               0
H
                                   H
                                   H
                                                    4-CF3
                                                                                               0
 H
                                                    4-0CF3
                                                                                               0
                                   H
 H
                                                    4-0(Q38-3-C1-5-CF3)
                                                                                               0
 H
                                   H
                                                    3,4-Cl<sub>2</sub>
                                                                                               0
H
                                   H
                                                    2-F-4-C1
                                                                                               0
 H
          H
                                                    2-F-4-0(C<sub>6</sub>H<sub>3</sub>-2-C1-4-CF<sub>3</sub>)
                                                                                               0
 H
          H
                     I
                                    H
 H
          H
                  CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
                                   H
                                                    4-C1
 H
          H
                  CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
                                                    4-CF3
                                                                                               0
                                                                                               0
                                                    4-0CF3
 H
          H
                  CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
                                                                                               0
 H
          H
                  CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
                                                    4-0(Q38-3-C1-5-CF<sub>3</sub>)
                                                                                                0
          H
                   CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
 H
                                                    3,4-Cl<sub>2</sub>
                                            * *【表29】
                                                    Y
                                                                                                Z
 R1
          R2
                      χı
                                    X21
                                                    2-F-4-C1
                                                                                                0
                   CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
 H
          H
                                    H
                   CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
                                                    2-F-4-0(C<sub>6</sub>H<sub>3</sub>-2-C1-4-CF<sub>3</sub>)
                                                                                                0
          H
 H
                                    H
                      CN
                                                                                                0
          H
                                    H
                                                    4-C1
 H
 H
        . Н
                      CN
                                    H
                                                    4-CF3
 Н
          H
                      CN
                                    H
                                                    4-0CF3
 ·H
          H
                      CN
                                    H
                                                    4-0(Q38-3-C1-5-CF3)
                      CN
                                                    3,4-Cl<sub>2</sub>
                                                                                                0
                                    H
 H
                                                                                                0
          H
                      CN
                                    H
                                                    2-F-4-C1
 H
                      CN
                                    H
                                                    2-F-4-0(C<sub>6</sub>H<sub>3</sub>-2-C1-4-CF<sub>3</sub>)
                                                                                                0
          H
                      NO<sub>2</sub>
 H
          H
                                    H
                                                     4-C1
 H
          H
                      NO<sub>2</sub>
                                    H
                                                    4-CF3
 H
          H
                      NO_2
                                    H
                                                    4-0CF<sub>3</sub>
                      NO<sub>2</sub>
                                    H
                                                    4-0(Q38-3-C1-5-CF<sub>3</sub>)
 H
                      NO<sub>2</sub>
                                    H
                                                    3.4-Cl<sub>2</sub>
                                    H
 H
                      NO_2
                                                    2-F-4-C1
                                    H
                                                    2-F-4-0(C<sub>6</sub>H<sub>3</sub>-2-C1-4-CF<sub>3</sub>)
                      NO_2
                      F
                                 6-F-3-NH<sub>2</sub>
                                                                                                0
 H
          H
                                                     4-C1
 H
          H
                      F
                                 6-F-3-NH<sub>2</sub>
                                                     4-Œ3
 H
          H
                      F
                                 6-F-3-NH2
                                                     4-0CF3
• Н
          Н
                      F
                                 6-F-3-NH2
                                                     4-0(Q38-3-C1-5-CF<sub>3</sub>)
 H
          H
                                 6-F-3-NH2
                                                     3,4-Cl<sub>2</sub>
 Н
          H
                      F
                                 6-F-3-NH<sub>2</sub>
                                                     2-F-4-C1
                                                     2-F-4-0(C<sub>6</sub>H<sub>3</sub>-2-C1-4-CF<sub>3</sub>)
 H
          H
                      F
                                 6-F-3-NH<sub>2</sub>
                                             ※ ※【表30】
                                                                                                Z
 Rı
           R²
                      χı
                                                     Y.
                                    X21
```

[0065]

[0066]

[0067]

(27)

	5	1			5 2	2			
	H	Н	F	4-F-6-C1	4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0			
[0068]				*	*【表32】				
	R1	R²	χ1	X <sup>2</sup> 1	Y.	Z			
•	Н	Н	F	4-F-6-C1	3, 4-Cl <sub>2</sub>	0			
	H	Н	F	4-F-6-C1	2-F-4-C1	0			
	H	H	F	4-F-6-C1	2-F-4-0(C6H3-2-C1-4-CF3)	0			
	Н	Н	F	5-F	4-C1	0			
	Н	Н	F	5-F	4-CF3	0			
	Н	Н	F	5-F	4-OCF3	0			
	H	H	F	5-F	4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0			
•	H	Н	F	5-F	3,4-Cl <sub>2</sub>	0			
	H	Н	F	5-F	2-F-4-C1	0			
	Н	Н.	F	5-F	2-F-4-0(C6H3-2-C1-4-CF3)	0			
	H	Н	OCH <sub>3</sub>	6-0 <b>0</b> H₃	4-C1	0			
	H	H	OCH₃	6-00H3	4-CF3	0			
	H	Н	$0CH_3$	6-00H3	4-0CF <sub>3</sub>	0			
	Н	H	OCH <sub>3</sub>	6-00H3	4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0			
,	. н	Н	OCH3	6-0CH3	3,4-Cl <sub>2</sub>	0			
	н	H	OCH₃	6-0Œl₃	2-F-4-Cl	0			
	H	H	OCH3	6-00H3	2-F-4-0(C6H3-2-C1-4-CF3)	0			
	Н	Н	C1	4-C1	4-C1	0			
	H	Н	CI	4-C1	4-CF3	0			
	H	H	Cl	4-C1	4-0CF <sub>3</sub> .	0			
	H	H	· C1	4-C1	4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0			
	Н	Н	C1	4-C1	3,4-Cl <sub>2</sub>	0			
	H	H	Cl	4-C1	2-F-4-C1	0			
[0069]	※ ※【表33】								
	R1	R <sup>2</sup>	χι	X <sup>2</sup> 1	Y.	Z			
	Н	Н	Cl	4-C1	2-F-4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	Ó			
	Н	CH₃	F	6-F	4-Cl	0			
	·H	СHз	F	6-F	4-Br	0			
	H	CH₃	F	6-F	4-CF <sub>3</sub>	0			
	Н	CH₃	F	6-F	4-0CF <sub>3</sub>	0			
	Н	· CH <sub>3</sub>	F	6-F	4-OCF2 CHF2	0			
	Н	CH₃	F	6 <del>.</del> F	3-0CF <sub>2</sub> 0-4	0			
	Н	CH₃	F	6-F	4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0			
	Н	ŒH₃	F	6-F	4-CH2ON=C(Q51) (C6H4-4-C1)	0			
	 H	CH <sub>3</sub>	F	6-F	4-0(Q38-3-C1-5-CF <sub>3</sub> )	0			
	. Н	CH₃	F	6-F	3,4-Cl <sub>2</sub>	0			
	. н	CH₃	F	6-F	3,5-Cl <sub>2</sub>	0			
	н	CH₃	F	6-F	3,4-Br <sub>2</sub>	0			
	 H	CH₃	F	6-F	2-F-4-C1	0			
•	 H	CH₃	F	6-F	2-F-4-0(C6H3-2-C1-4-CF3)	0			
	 H	CH₃	F	6-F	2-F-4-0(Q38-3-C1-5-CF <sub>3</sub> )	0			

```
特開平8-27120
                                     (28)
                                                                             54
  53
        СHЗ
                  F
                              6-F
                                             3-F-4-C1
H
                                                                                   0
H
        ŒЫ
                  F
                              6-F
                                             3-C1-4-Br
                                                                                    0
        СНз
                  F
                              6-F
                                             2,5-F2-4-C1
H
                                                                                    0
                                             3,4,5-Cl<sub>3</sub>
H
        СНз
                  F
                              6-F
                                                                                    0
H
        СHз
                  F
                              6-F
                                             3,5-Cl2-4-OCF2 CHF2
                  F
                              6-F
                                             3,5-C1_2-4-0(038-3-C1-5-CF_3)
Н
        СНз
                                                                                    0
        СНз
                  F
                              6-F
                                             2, 4-F2-3, 5-Cl2
H
                                           *【表34】
        R²
                  χı
                              χ²ı
                                             Y.
                                                                                    2
\mathbb{R}^1
                                                                                    S
                                             4-C1
H
        H
                  F
                              6-F
                                                                                    S
H
        H
                   F
                               6-F
                                             4-Br
                                                                                    S
                               6-F
                                             4-Œ3
H
        H
                                                                                    S
H
        H
                   F
                               6-F
                                             4-0CF3
                   F
                                             4-OCF2 CHF2
                                                                                    S
                               6-F
H
        H
                                                                                    S
                                             3-0CF<sub>2</sub>0-4
H
        H
                               6-F
                   F
                                             4-0(C<sub>6</sub>H<sub>3</sub>-2-C<sub>1</sub>-4-CF<sub>3</sub>)
                                                                                    S
H
        H
                               6-F
                                                                                    S
H
                   F
                               6-F
                                             4-CH2ON=C(Q51)(C6H4-4-C1)
        H
                                                                                    S
Н
        H
                   F
                               6-F
                                             4-0(Q38-3-C1-5-CF<sub>3</sub>)
                                                                                    S
                   F
H
        H
                               6-F
                                             3,4-Cl<sub>2</sub>
                   F
                               6-F
                                             3,5-Cl<sub>2</sub>
                                                                                    S
H
        H
        H
                   F
                               6-F
                                             3,4-Br<sub>2</sub>
                                                                                    S
H
                                                                                    S
                   F
                                              2-F-4-C1
H
        H
                               6-F .
                                                                                    S
H
        H
                   F
                               6-F
                                              2-F-4-0(C6H3-2-C1-4-CF3)
                                                                                    S
                                              2-F-4-0(Q38-3-C1-5-CF3)
H
        H
                   F
                               6-F
                                                                                    S
                   F
H
        H
                               6-F
                                              3-F-4-C1
                   F
                               6-F
                                              3-C1-4-Br
                                                                                    S
H
        H
                                                                                    S
                   F
                               6-F
                                              2,5-F2-4-C1
H
        H
                                                                                    S
H
        H
                   F
                               6-F
                                              3,4,5-Cl<sub>3</sub>
                                                                                     S
H
        H
                   F
                               6-F
                                              3,5-C12-4-OCF2CHF2
                                              3,5-Cl2-4-O(Q38-3-Cl-5-CF3) S
H
        H
                   F
                               6-F
                                                                                     S
                                              2,4-F2-3,5-Cl2
H
         H
                               6-F
                                                                                     0
                                              4-C1
         CH2 CH3 F
                               6-F
                                      ※ ※【表35】
                                                                                . Z
         R2
                   χı
                                              Y.
\mathbb{R}^1
                               X21
                                                                                     0
 H
         CH2 CH3 F
                               6-F
                                              4-Br
                                                                                     0
 H
         CH<sub>2</sub> CH<sub>3</sub> F
                               6-F
                                              4-CF3
                                                                                     0
 H
         CH2CH3 F
                               6-F
                                              4-0CF3
                                                                                     0
 H
         CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> F
                               6-F
                                              4-OCF2 CHF2
                                                                                     0
                                              3-0CF<sub>2</sub>0-4
 H
         CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> F
                                6-F
                                                                                     0
                                              4-0(C<sub>6</sub>H<sub>3</sub>-2-C1-4-CF<sub>3</sub>)
 H
         CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> F
                                6-F
                                              4-CH<sub>2</sub>ON=C(Q51) (C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>-4-Cl)
                                                                                     0
 Н
         CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> F
                                6-F
                                                                                     0
                                              4-0(Q38-3-C1-5-CF<sub>3</sub>)
 H
         CH2CH3 F
                                6-F
                                                                                     0
 H
         CH2CH3 F
                                6-F
                                              3,4-Cl<sub>2</sub>
                                                                                     0
                                              3,5-Cl<sub>2</sub>
 H
         CH2CH3 F
                                6-F
```

[0070]

[0071]

```
(29)
                                                                                              特開平8-27120
                                                                                    56
  55
Н
         CH2CH3 F
                                 6-F
                                                 3,4-Br<sub>2</sub>
                                                                                           0
                                                                                           0
         CH2CH3 F
                                                  2-F-4-C1
H
                                 6-F
                                                                                           0
H
         CH2CH3 F
                                 6-F
                                                  2-F-4-0(C<sub>6</sub>H<sub>3</sub>-2-Cl-4-CF<sub>3</sub>)
                                                                                           0
         CH2CH3 F
                                 6-F
                                                  2-F-4-0(Q38-3-C1-5-CF_3)
H
                                                                                           0
H
         CH2 CH3 F
                                 6-F
                                                  3-F-4-C1
                                                                                           0
                                 6-F
                                                  3-C1-4-Br
H
         CH<sub>2</sub> CH<sub>3</sub> F
                                                                                           0
H
         CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> F
                                 6-F
                                                  2,5-F2-4-C1
                                                                                           0
         CH2CH3 F
                                 6-F
                                                  3,4,5-Cl<sub>3</sub>
H
                                                                                            0
         CH2 CH3 F
                                 6-F
                                                  3,5-Cl2-4-OCF2CHF2
H
                                                  3,5-Cl2-4-0(Q38-3-Cl-5-CF3)
H
         CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> F
                                 6-F
         CH2 CH3 F
                                                  2, 4-F2-3, 5-Cl2
                                                                                            0
H
                                 6-F
                                                                                            NH
H
                    F
                                  6-F
                                                  4-0CF3
         H
                                                                                            NH
                                                  4-0(Q38-3-C1-5-CF<sub>3</sub>)
H
         H
                                  6-F
                                          * *【表36】
\mathbb{R}^1
         R²
                          χı
                                     X21
                                                                                            Z
                                                  Y
H
                           F
                                     6<del>-</del>F
                                                  3,4-Cl<sub>2</sub>
                                                                                            NH
         H
                                                                                            NH
H
         H
                                     6<del>-</del>F
                                                  2-F-4-C1
                                                                                            NH
H
         H
                                     6-F
                                                  2-F-4-0(C6H3-2-C1-4-CF3)
                                                                                            NH
                                                  4-C1
H
         H
                                     6-F
                                     6<del>-F</del>
                                                  4-CF3
                                                                                            NH
H
         H
H
         CH<sub>2</sub> CH<sub>2</sub> CH<sub>3</sub>
                                     6-F
                                                  4-0CF3
                                                                                            0
H
         CH2 CH2 CH3
                                     6-F
                                                  4-0(Q38-3-C1-5-CF3)
                                                                                            0
                                                                                            0
H
         CH2 CH2 CH3
                                     6-F
                                                  3,4-Cl<sub>2</sub>
                                                  2-F-4-C1
                                                                                            0
H
         CH2 CH2 CH3
                                     6-F
                                                                                            0
                                     6-F
                                                  2-F-4-0(C<sub>6</sub>H<sub>3</sub>-2-C<sub>1</sub>-4-CF<sub>3</sub>)
H
          CH2 CH2 CH3
H
          CH<sub>2</sub> CH<sub>2</sub> CH<sub>3</sub>
                                     6-F
                                                  4-C1
                                                                                            0
                                                                                            0
H
          CH2 CH2 CH3
                           F
                                     6-F
                                                  4-CF3
 СНз
          СЊ
                                     6-F
                                                  4-0CF3
                                                                                            0
 СЊз
          CНз
                                     6<del>-</del>F
                                                  4-0(Q38-3-C1-5-CF3)
                                                                                             0
                                                                                             0
                           F
 CH3
          СHз
                                     6-F
                                                 3,4-Cl<sub>2</sub>
                                                                                            0
          СHз
                                                  2-F-4-C1
 CHa
                                     6-F
                                                  2-F-4-0(C6H3-2-C1-4-CF3)
                                                                                            0
          СНз
                                     6<del>-F</del>
 CH3
                                     6-F
                                                   4-C1
                                                                                            0
 CH3
          ŒЫ
                                     6<del>-F</del>
                                                   4-CF3
                                                                                             O
 CH₃
          CHз
 H
          Co Ho
                           F
                                     6-F
                                                   4-0CF3
                                                                                             0
                                                   4-0(Q38-3-C1-5-CF<sub>3</sub>)
                                                                                             0
 H
          C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>
                           F
                                     6-F
 H
          Co Ho
                           F
                                     6-F
                                                  3,4-Cl<sub>2</sub>
                                                                                             0
                                                                                             0
          C<sub>6</sub> H<sub>5</sub>
                                     6-F
                                                   2-F-4-C1
 H
                                                ※【表37】
                                                                                             Z
 R^1
          R2
                           χı
                                     X21
                                                      Yn
                           F
                                                      2-F-4-0(C6H3-2-C1-4-CF3)
                                                                                             0
 H
          Co Ho
                                      6-F
                                                                                             0
 H
                           F
                                                      4-C1
          Co Ho
                                      6-F
                           F
                                      6-F
                                                                                             0
 H
          C<sub>6</sub> H<sub>5</sub>
                                                      4-CF3
                                                                                             0
 H
          CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
                           F
                                      6-F
                                                      4-0CF<sub>3</sub>
```

[0072]

[0073]

			(3	0)	特開
- 57	7			. 58	
H	CH (CH <sub>3</sub> ) 2	F	6 <del>-</del> F	4-0(Q38-3-C1-5-Œ₃)	0
H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	F	6 <del>-</del> F	3, 4-Cl <sub>2</sub>	0
H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	F	6 <del>-F</del>	2-F-4-C1	0
H	CH (CH3) 2	F	6 <del>-F</del>	2-F-4-0(C6H3-2-C1-4-CF3)	0
H	CH (CH3) 2	F	6-₽	4-C1	0
H	CH (CH3)2	F	6 <del>-F</del>	4-CF <sub>3</sub>	0
H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	F	6 <del>-</del> F	4-0CF <sub>3</sub>	0
H	C(CH3)3	F	6 <del>-F</del>	4-0(Q38-3-C1-5-Œ₃)	0
H	C(CH3)3	F	6 <del>-F</del>	3, 4-Cl <sub>2</sub>	0
H	C(CH3)3	F	6 <b>-</b> F	2-F-4-C1	0
H	C(CH3)3	F	6 <del>-F</del>	2-F-4-0(C6H3-2-C1-4-CF3)	0
H	C(CH3)3	F	6 <del>-F</del>	4-C1	0
H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	F	6 <del>-</del> F	4-CF <sub>3</sub>	0
H	CH2 CH=CH2	F	6 <del>-</del> F	4-0CF3	0
H	CH2 CH=CH2	F	6 <b>-</b> F	4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0
H	CH2 CH=CH2	F	6-F	3, 4-Cl <sub>2</sub>	0
H	CH₂ CH=CH₂	F	6-F	2-F-4-C1	0
H	CH2 CH=CH2	F	6-F	2-F-4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0
H	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	F	6 <b>-F</b>	4-C1	0 .
			*	*【表38】	
R1	R <sup>2</sup>	Χı	X21	Ya	Z
Н	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	F	6-F	4-CF3 ·	0
H	$CH_2C\equiv CH$	F	<del>6-</del> F	4-0CF3	0
u	$Q_{\bullet} C = Q$	E	<b>4_F</b>	4-0(038-3-C1-5-CF <sub>2</sub> )	n

[0074]

R1	R²	Χı	X <sup>2</sup> 1	Ya	Z
<u>н</u>	CH2 CH=CH2	F	6-F	4-CF <sub>3</sub>	0
H	$CH_2C\equiv CH$	F	<del>6-F</del>	4-0CF <sub>3</sub>	0
H	$CH_2C\equiv CH$	F	6 <del>-</del> F	4-0(Q38-3-C1-5-Œ3)	0
H	$CH_2C\equiv CH$	F	6 <del>-F</del>	3,4-Cl <sub>2</sub>	0
H	$CH_2C\equiv CH$	F	6 <del>-F</del>	2-F-4-C1	0
H	$CH_2C\equiv CH$	F	6 <del>-F</del>	2-F-4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0
H	$CH_2C\equiv CH$	F	6 <del>-</del> F	4-C1	0
H	$CH_2C\equiv CH$	F	6-F	4-CF <sub>3</sub>	0
H	CHF <sub>2</sub>	F	6-F	4-0CF3	0
H	CHF <sub>2</sub>	F	6-F	4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0
H	CHF <sub>2</sub>	F	6 <del>-</del> F	3, 4-C1 <sub>2</sub>	. 0
H	CHF <sub>2</sub>	F	6 <del>-F</del>	2-F-4-C1	0
H	CHF2	F	6 <del>-F</del>	2-F-4-0(C <sub>6</sub> H <sub>2</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0
H	CHF <sub>2</sub>	F	6 <del>`</del> ₽	4-C1	0
H	CHF <sub>2</sub>	F	6 <del>-F</del>	<b>4-CF</b> 3	0
H	CF <sub>3</sub>	F	6 <del>-F</del>	4-OCF3	0
H	CF <sub>3</sub>	F	6 <del>-F</del>	4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0
H	Œ3	F	6-F	3, 4-Cl <sub>2</sub>	0
H	Œ3	F	6-F	2-F-4-C1	0
H	Œ₃	F	6-F	2-F-4-0(C6H3-2-C1-4-CF3)	0
H	Œ3	F	6 <b>-F</b>	4-C1	0
Н	CF₃	F	6 <b>-</b> F	4-CF <sub>3</sub>	0
H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	F	6-F	4-0CF3	0

[0075]

※ ※【表39】

5 9	•			60	
$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	X1	X2 <sub>1</sub>	Ye	Z
			, _		
H	CH2OCH3	F	6 <del>-F</del>	4-0(Q38-3-C1-5-CF <sub>3</sub> )	0
H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	F	6 <del>-F</del>	3,4-Cl <sub>2</sub>	0
H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	F	6 <del>-F</del>	2-F-4-Cl	0
H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	F	6 <del>-</del> F	2-F-4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0
H	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	F	6 <del>-F</del>	4-C1	0
H	CH₂OCH₃	F	6 <del>-</del> F	4-CF3	0
H	CH2CH2OCH3	F	6 <del>-F</del>	4-0CF3	0
H	CH2 CH2 OCH3	F	6-F	4-0(Q38-3-C1-5-CF₃)	0
H	CH2CH2OCH3	F	6 <del>-</del> F	3,4-Cl <sub>2</sub>	0
H		F	6 <del>-F</del>	2-F-4-C1	0
H	CH2 CH2 OCH3	F	6 <del>-</del> F	2-F-4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0.
H		F	6 <del>-F</del>	4-C1	0
H	CH2 CH2 OCH3	F	6 <del>-</del> F	4-CF <sub>3</sub>	0
H	CH2 CH2 OCH3	F	6 <del>-F</del>	4-0CF <sub>3</sub>	0
H	Q51	F	6-F	4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0
H	<b>Q</b> 52	F	6 <del>-F</del>	3, 4-Cl <sub>2</sub>	0
H	<b>Q53</b>	F	6-F	2-F-4-C1	0
H	Q54	F	6-F	2-F-4-0(C6H3-2-C1-4-CF3)	0
H	CH <sub>2</sub> C1	F	6 <del>-</del> F	4-Cl	0
H	CH=C(C1)CF3	F	6 <del>-F</del>	4-CF3	0
н -	$CH_2C \equiv CBr$	F	6 <del>-F</del>	4-0CF3	0
H	(Q54-1-C1)	F	6 <del>-</del> F	4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0
H	(CH <sub>2</sub> )5CH <sub>3</sub>	F	6 <b>-F</b>	3, 4-Cl <sub>2</sub>	0

[0076]

*	*	【表40】	

R1	R <sup>2</sup>	X1	X <sup>2</sup> 1	Yn	Z
Н	(C6H4-4-C1)	F	6 <b>-</b> F	2-F-4-C1	0
H	(C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CF <sub>3</sub> )	F	6-F	2-F-4-0(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-C1-4-CF <sub>3</sub> )	0
H	(C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-OCF <sub>3</sub> )	F	6 <del>-F</del>	4-C1	0
H.	(C6H3-3,4-Cl2)	F	6-F	4-CF <sub>3</sub>	0
H	(C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -2-F-4-C1)	F	6 <del>-</del> F	4-0CF3	0
Н	(C6H4-4-SCF3)	F	6 <del>-F</del>	4-0(Q38-3-C1-5-CF3)	0
••	(2011, 1 0010)	•	• •		•

【0077】本発明において有害生物防除剤とは、特に 害虫防除剤を意味する。本発明化合物は極めて低い薬剤 濃度で各種の有害な害虫に対して効力を示す。その害虫 40 としては、例えば、ツマグロヨコバイ、トピイロウン カ、モモアカアブラムシ、ニジュウヤホシテントウ、ハ スモンヨトウ、コブノメイガ、コナガ等の農業害虫、ナ ミハダニ、ミカンハダニ、カンザワハダニ等のハダニ 類、アカイエカ、イエバエ、チャバネゴキブリ、アリ、 ノミ、シラミ等の衛生害虫、コクゾウムシ、コクヌスト モドキ、スジマダラメイガ等の貯穀害虫、シロアリのよ うな家屋害虫、ダニ、ノミ、シラミ等の家畜害虫、コナ ダニ、ヒョウヒダニ、ツメダニ等の屋内塵性ダニ、ナメ クジ、カタツムリ等の軟体動物等が挙げられる。すなわ※50 はナトリウム、カリウム等のアルカリ金属を示す。

※ち、本発明化合物は直翅目、半翅目、鱗翅目、鞘翅目、 膜翅目、双翅目、シロアリ目およびダニ・シラミ類の害 虫を低濃度で有効に防除できる。一方、本発明化合物は ホ乳類、魚類、甲殻類および益虫に対してはほとんど悪 影響がない極めて有用な化合物であることを見出し、本 発明を完成した。

【0078】次に、本発明化合物の製造法について説明 する。本発明化合物は新規なテトラヒドロビリミジノン 誘導体であり、代表的な製造法を以下に具体的に説明す

【0079】各方法 (A法~B法) において、R1、R2、 X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、Y、Z、1及びmは前記と同じ意味を示し、M.

\*【化11】

A法

61

$$X^{1} \xrightarrow{O} \begin{array}{c} R^{1} R^{2} \\ X^{2} \xrightarrow{O} \end{array} \xrightarrow{N} \begin{array}{c} X^{1} \xrightarrow{O} \\ X^{2} \xrightarrow{O} \end{array} \xrightarrow{N} \begin{array}{c} X^{1} \xrightarrow{N} \\ X^{2} \xrightarrow{O} \end{array} \xrightarrow{N} \begin{array}{c} X^{1} \xrightarrow{N} \\ X^{2} \xrightarrow{N} \xrightarrow{N} \begin{array}{c} X^{1} \xrightarrow{N} \\ X^{2} \xrightarrow{N} \end{array} \xrightarrow{N} \begin{array}{c} X^{1} \xrightarrow{N} \\ X^{1} \xrightarrow{N} \end{array} \xrightarrow{N} \begin{array}{c} X^{1} \xrightarrow{N} \xrightarrow{N} \begin{array}{c} X^{1} \xrightarrow{N} \\ X^{2} \xrightarrow{N} \end{array} \xrightarrow{N} \begin{array}{c} X^{1} \xrightarrow{N} \\ X^{2} \xrightarrow{N} \xrightarrow{N} \xrightarrow{N} \begin{array}{c} X^{1} \xrightarrow{N} \end{array} \xrightarrow{N} \begin{array}{c} X^{1} \xrightarrow{N} \xrightarrow{N} \xrightarrow{N} \begin{array}{c} X^{1} \xrightarrow{N} \end{array} \xrightarrow{N} \begin{array}{c} X^{1} \xrightarrow{N} \xrightarrow{N} \begin{array}{c} X^{1} \xrightarrow{N} \end{array} \xrightarrow{N} \begin{array}{c} X^{1} \xrightarrow{N} \xrightarrow{N} X^{1} \xrightarrow{N} \xrightarrow{N} \xrightarrow{N} \xrightarrow{N} \xrightarrow{N} X^{1} \xrightarrow{N} \xrightarrow{N} \xrightarrow{N} X$$

【0081】化合物(II)と化合物(III)とを不活性な溶媒中で反応させることにより本発明化合物(I)が得られる。化合物(III)はMとしては、ナトリウム、カリウム等のアルカリ金属であるシアン酸またはチオシアン酸のアルカリ金属塩である。溶媒としては、酢酸、ギ酸等の有機酸を用いるのが好ましい。また化合物(1 ※ B 法

10※I)を塩化水素や臭化水素の塩として用いると反応が進行し易い。反応温度は0℃から反応混合物の湿流温度までの任意の温度を設定できるが、室温から80℃までで行うのが好ましい。

62

【0082】 【化12】

(VI)

【0083】本法はR<sup>1</sup>=R<sup>2</sup>=水素原子である場合の出発原料(II)の合成法である。化合物(IV)と化合物(V)をホルマリンまたはパラホルムアルデヒドと反応させて化合物(VI)を得た後、化合物(VII)と反応させることにより出発原料(II)のR<sup>1</sup>=R<sup>2</sup>=水素原子である化合物(VIII)を得ることができる。B1工程は酸触媒の存在下、不活性な溶媒中で行うのが好ましい。酸触媒としては塩酸、硫酸またはパラトルエンスルホン酸等を化合物(IV)に対して0.1-10%程度用いるのが好ましい。溶媒としてはメタノール、エタノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類及び水等が挙げられる。これらの不活性溶媒は単独で使用してもよく、また、混合して使用することもできる。一般★50

★的にはメタノール、エタノール等のアルコール類と水の混合物を用いるのが好ましい。反応温度は0℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができるが、室温から還流温度までで行なうのが好ましい。【0084】B2工程において用いられる溶媒としては、B1工程と同様のものが挙げられ、一般的にはメタノール、エタノール等のアルコール類と水の混合溶媒を用いるのが好ましい。反応温度は0℃から反応混合物の還流温度までで行なうのが好ましい。化合物(VIII)はメタノール、エタノール等のアルコール中で濃塩酸または臭化水素水を加えることにより容易に塩酸塩または臭化水素塩とすることができる。

【0085】各方法において、各反応物質のモル比には

特に制限はないが、等モル又はそれに近い比率で反応を 行なうのが有利である。

【0086】本発明化合物を精製する必要が生じた場合は、再結晶、カラムクロマトグラフィー、薄層クロマトグラフィー等の任意の精製方法によって分離、精製することができる。

【0087】本発明化合物を有寄生物防除剤として施用するにあたっては、一般には適当な担体、例えばクレー、タルク、ベントナイト、珪藻土、ホワイトカーボン等の固体担体あるいは水、アルコール類(イソプロパノ 10ール、ブタノール、ベンジルアルコール、フルフリルアルコール等)、芳香族炭化水素類(トルエン、キシレン等)、エーテル類(アニソール等)、ケトン類(シクロヘキサノン、イソホロン等)、エステル類(酢酸ブチル等)、酸アミド類(Nーメチルピロリドン等)又はハロゲン化炭化水素類(クロルベンゼン等)などの液体担体と混用して適用することができ、所望により界面活性剤、乳化剤、分散剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、因結防止剤、安定剤などを添加し、液剤、乳剤、水和剤、ドライフロアブル剤、フロアブル剤、粉剤、粒 20 剤等任意の剤型にて実用に供することができる。

【0088】また、本発明化合物は必要に応じて製剤時 又は散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺ダニ剤、殺 線虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壌 改良剤などと混合施用しても良い。

【0089】特に他の農薬あるいは植物ホルモンと混合施用することにより、施用薬量の減少による低コスト化、混合薬剤の相乗作用による殺虫スペクトラムの拡大や、より高い有害生物防除効果が期待できる。この際、同時に複数の公知農薬との組み合わせも可能である。本30発明化合物と混合使用する農薬の種類としては、例えば、ファーム・ケミカルズ・ハンドブック(Farm Chemicals Handbook)1994年版に記載されている化合物などがある。

【0090】本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール(ha)当たり0.005~50kg程度が適当である。

【0091】次に具体的に本発明化合物を用いる場合の 製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらの 40 みに限定されるものではない。なお、以下の配合例にお いて「部」は重量部を意味する。

### 【0092】〔水和剤〕

本発明化合物・・・・・ 5~80部 固体担体 ・・・・・・10~85部 界面活性剤 ・・・・・・ 1~10部 その他 ・・・・・・ 1~5 部 その他として、例えば固結防止剤などがあげられる。 【0093】〔乳 剤〕

本発明化合物・・・・・・ 1~30部

64

液体担体 ·····30~95部 界面活性剤 ····· 5~15部

【0094】〔フロアブル剤〕

本発明化合物・・・・・ 5~70部 液体担体 ・・・・・ 15~65部 界面活性剤 ・・・・・ 5~12部 その他 ・・・・・ 5~30部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等があげられる.

【0095】〔粒状水和剤(ドライフロアブル剤)〕

本発明化合物・・・・・20~90部 固体担体 ・・・・・・10~60部 界面活性剤 ・・・・・ 1~20部

【0096】〔粒 剤〕

本発明化合物・・・・・0.1 ~10部 固体担体 ·・・・・・90~99.9 部 その他 ·・・・・・ 1~5 部

【0097】〔粉 剤〕

本発明化合物・・・・・・0.01~30部 ) 固体担体 ・・・・・・67~99.5 部 その他 ・・・・・・ 0~3 部

[0098]

#### 【実施例】

実施例(合成例、製剤例、試験例)

以下、本発明について実施例(合成例、製剤例、試験例)を挙げて具体的に詳述する。

【0099】〔合成例〕本発明に包含される化合物は、 以下に示した合成例に基づき製造した又は製造すること ができるが、本発明はこれらの化合物にのみ限定される ものではない。

### 【0100】合成例1

3-(4-クロロアニリノ)-2',6'-ジフルオロアロピオフェノン塩酸塩1.52gを氷酢酸24m1に溶解し、撹拌しつつ60℃に加温する。60℃にてシアン酸カリウム0.95gを一度に加えると発熱的に反応が進行する。60℃にて更に4時間撹拌を続けた後、室温まで放冷し、反応混合物を氷水100m1に注ぎ、析出した結晶を沪別する。沪取した結晶は酢酸エチル150m1に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液100m1、水50m1及び3N塩酸100m1の順で洗浄し、次いで飽和食塩水で脱水、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下に溶媒を留去し、得られた結晶をジイソプロピルエーテルージエチルエーテルの混合溶媒にて洗浄することにより表題化合物の白色結晶1.28gを得た。(収率87.1%)

融点: 214.5-216.0℃

50 【0101】合成例2

65

1-(4-)クロロフェニル) -4-(2-)クロロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリミジン-2-チオン(本発明化合物No. 5)

3-(4-クロロアニリノ)-2'-クロロプロピオフェノン塩酸塩1.5gをエタノール24m1に溶解する。これにチオシアン酸カリウム0.49gを加え、5時間加熱湿流した後、室温まで放冷した反応混合物を氷水100m1に注ぐ。結晶の折出した懸濁液を酢酸エチル100m1にて抽出、水層はさらに酢酸エチル50m1にて洗浄する。酢酸エチル層を合わせて飽和炭酸水素 10ナトリウム水溶液100m1、水50m1、さらに3N塩酸100m1の順で洗浄し、次いで飽和食塩水で脱水、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。減圧下に溶媒を留去し、得られた黄色結晶をジエチルエーテルにて洗浄することにより表題化合物の黄色結晶0.73gを得た。(収率48%)

融点:181.5-184.0℃

【0102】参考例1

3-ジメチルアミノー2'-クロロプロピオフェノン塩 酸塩

2'-クロロアセトフェノン18.25g、ジメチルアミン塩酸塩12.5g、パラホルムアルデヒド4.7gを濃塩酸0.25m1を含有するエタノール20m1中にて還流下に撹拌する。4時間後還流を止めてアセトン95m1を添加し、室温まで放冷、更に冷蔵庫にて一夜放置すると白色結晶が析出してくる。析出した結晶を手早くデ別し、少量のアセトンにて洗浄することにより、表題化合物の白色結晶18.65gを得た。(収率63.7%)

【0103】参考例2

6.6

\*6'ージフルオロプロピオフェノン塩酸塩 3-ジメチルアミノ-2',6'-ジフルオロプロピオ フェノン塩酸塩2.15gをエタノール-水(1:1) 混合溶媒10m1に加え、室温にて撹拌する。結晶が完 全に溶解した後、4ートリフルオロメトキシアニリン 1.52gを添加し、1時間加熱湿流する。反応中分離 してきた黄色油状物は室温まで放冷すると固化する。水 5mlを加え、固体を十分研和した後、沪温、エタノー ルー水(1:2)混合溶媒にて洗浄することにより、3 ージフルオロプロピオフェノンの粗物を黄色固体として 得る。得られた固体をエタノール50m1に溶解し、濃 塩酸2mlを加えて撹拌後、溶媒を減圧下に留去し、十 分に結晶が析出するまで濃縮する。 残渣にジエチルエー テルを加えて放冷後、結晶を手早く沪別、ジエチルエー テルにて洗浄することにより表題化合物の白色板状晶 1.97gを得た。(収率60.1%)

【0104】上記合成例に従って、第2表に示す化合物を合成した。

20 【0105】第 2 表 【0106】

【化13】

$$X^{1} \xrightarrow{R^{1} R^{2}} Z$$

$$X^{2} \xrightarrow{H} Z$$

$$(1)$$

【0107】 【表41】

No.	R1	R²	Χı	X <sup>2</sup> 1	Y.	Z	融点		
1	Н	Н	Cl	Н	4-C1	0	227.5-229.0		
2	H	H	Cl	H	4-0CF3	0	203.5-205.0		
3	H	H	F	6 <del>-F</del>	4-C1	0	214.5-216.0		
4	H	H	F	6 <del>-</del> F	4-0CF <sub>3</sub>	0	208.5-210.0		
5	H	H	Cl	H	4-C1	S	181.5-184.0		
6	H	H	Cl	Н	4-0CF3	S	152.0-153.5		
7	H	H	F	Н	4-0CF3	0	197.5-200.0		
8	H	H	F	H	4-C1	0	187.5-189.5		
9	Н	H	· F	6 <del>-</del> F	3,4-C1 <sub>2</sub>	0	215.0-217.0		

【0108】〔製剤例〕次に、本発明化合物を有効成分とする有害生物防除剤の製剤例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。尚、以下の製剤例において、「部」は重量部を意味する。

【0109】〔製剤例1〕水和剤

本発明化合物 ・・・・・・・50部

 ※ジークライトPFP ・・・・・・・・43部 (カオリン系クレー:ジークライト工業(株)商品名) ソルボール 5050 ・・・・・・・ 2部 (アニオン性界面活性剤:東邦化学工業(株)商品名) ルノックス 1000 C ・・・・・・・ 3部

※50 (アニオン性界面活性剤: 東邦化学工業(株)商品名)

(	<b>ラ</b> フノ	
. 67		• 68
カープレックス#80(固結防止剤)・・・ 2部		ブル剤、粒状水和剤は水で50~20000倍に希釈し
(ホワイトカーボン:塩野義製薬(株)商品名)		て有効成分が1ヘクタール (ha) 当たり0.005~5
以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。		0kgになるように散布する。
【0110】〔製剤例2〕乳 剤		【0116】〔試験例〕次に、本発明化合物の有害生物
本発明化合物 ・・・・・・・ 3部		防除剤としての有用性について、以下の試験例において
キシレン ・・・・・・76部		具体的に説明する。
イソホロン ・・・・・・・15部		【0117】試験例1 トビイロウンカに対する殺虫試
ソルポール3005X ······ 6部		驗
(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混		明細書に記載された本発明化合物の5%乳剤(化合物に
合物:東邦化学工業(株)商品名)		よっては25%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈
以上を均一に混合して乳剤とする。	10	して、1000 ppm濃度の薬液に調製した。この薬液を1/2
以上を切った低音して孔別とりる。 【0111】〔製剤例3〕フロアブル剤		0,000アールのボットに植えたイネの茎葉に十分量散布
		した。風乾後、円筒をたて、トビイロウンカの2令幼虫
本発明化合物 ・・・・・・・35部		をポット当たり、10頭放虫し、蓋をし、恒温室に保管し
アグリゾールS-711 ・・・・・・ 8部		
(非イオン性界面活性剤:花王(株)商品名)		た。調査は6日経過後に行い死虫率を下記の計算式から
ルノックス 1000 C · · · · · · · · · 0.5部	•	求めた。尚、試験は2区制で行なった。
(アニオン性界面活性剤:東邦化学工業(株)商品名)		[0118]
1%ロドボール水 ・・・・・・20部		死虫率 (%) = (死虫数/放虫数)×100
(増粘剤:ローン・プーラン社商品名)		その結果、以下の化合物が100%の死虫率を示した。
エチレングリコール(凍結防止剤)・・・・ 8部・・・・	20	【0119】本発明化合物: No. 1, 2, 3, 4。
水 · · · · · · · · · · 28.5部		【0120】試験例2 ハスモンヨトウに対する殺虫試
以上を均一に混合して、フロアブル剤とする。		By the second se
【0112】〔製剤例4〕粒状水和剤(ドライフロアブ		明細書に記載された本発明化合物の5%乳剤(化合物に
ル剤)		よっては25%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈
本発明化合物・・・・・・・75部		して、1000ppm濃度の薬液に調製し、この薬液中にカン
イソバンNo.1 ・・・・・・10部		ランの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、こ
(アニオン性界面活性剤:クラレイソプレンケミカル		の中にハスモンヨトウ2令幼虫をシャーレ当たり10頭を
(株) 商品名)		放虫し、孔のあいた蓋をして25°C恒温室に収容し、6日
バニレックスN ・・・・・・・ 5部		間経過後の死虫率を下記の計算式から求めた。尚、試験
(アニオン性界面活性剤:山陽国策パルプ(株)商品	30	は2区制で行なった。
名)		[0121]
カープレックス#80 ・・・・・・10部		死虫率 (%) = (死虫数/放虫数) × 100
(ホワイトカーボン:塩野義製薬(株)商品名)		【0122】その結果、以下の化合物が100%の死虫
以上を均一に混合微粉砕してドライフロアブル剤とす		率を示した。
<b>ઢ.</b>		本発明化合物: No. 2, 3, 4, 7。
【0113】〔製剤例5〕粒 剤		【0123】試験例3 ニジュウヤホシテントウに対す
本発明化合物 ・・・・・・・0.1部		る殺虫試験
ベントナイト ・・・・・・55.0部		明細書に記載された本発明化合物の5%乳剤(化合物に
タルク ・・・・・・44.9部		よっては25%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈
以上を均一に混合粉砕した後、少量の水を加えて攪拌混	40	して、1000pp■濃度の薬液に調製し、この薬液中にトマ
合捏和し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤にす		トの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この
<b>ઢ.</b>		中にニジュウヤホシテントウ2令幼虫をシャーレ当たり
【0114】〔製剤例6〕粉 剤		10頭を放虫し、蓋をして25℃恒温室に収容し、6日間経
本発明化合物 ・・・・・・3.0部		過後の死虫率を下記の計算式から求めた。 尚、試験は2
カープレックス#80 ・・・・・・0.5部		区制で行なった。
(ホワイトカーボン:塩野義製薬(株)商品名)		[0124]
クレー ・・・・・・・ 95部		死虫率 (%) = (死虫数/放虫数) × 100
リン酸ジイソプロピル ・・・・・・1.5部		【0125】その結果、以下の化合物が100%の死虫
以上を均一に混合粉砕して粉剤とする。		率を示した。
【0115】使用に際しては上記水和剤、乳剤、フロア	50	

[0126]

【発明の効果】本発明化合物は多くの農業害虫、ハダニ 類に対して優れた殺虫・殺ダニ活性を有し、かつホ乳 類、魚類及び益虫に対してはほとんど悪影響を及ぼさない。従って、本発明化合物は、有用な有害生物防除剤を 提供することができる。

70

フロントペー	-ジの続き	•				
(51) Int. Cl. (	5 .	識別記号	庁内整理番号	FI	技術表示箇所	f
A 0 1 N	43/58					
	43/60					
	43/647					
	43/653		•			
	43/76					
	43/78					
	43/80	101				
		102				
	43/832			•		
	43/836					
C07D		239				
	403/12	207	•			
		231				
,		233				
		237		•		
•		239				
	405/12	239			·	
	409/12	239			·	
	413/12	239		•		
	417/12	239				
(72)発明者	工藤 正毅			(72) 発明者	井上 洋一	
	東京都千代	田区神田錦町3	3-7-1 日産		埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日	産
	化学工業株	式会社内			化学工業株式会社生物科学研究所内	
				(72)発明者	三宅 敏郎	
					埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日	産
				•	化学工業株式会社生物科学研究所内	